

Patent Abstracts of Japan

PUBLICATION NUMBER : 59049840
PUBLICATION DATE : 22-03-84

APPLICATION DATE : 14-09-82
APPLICATION NUMBER : 57160419 ✓

APPLICANT : TAIYO YAKUHIN KOGYO KK;

INVENTOR : ADACHI HIDEO;

INT.CL. : B01J 2/30

TITLE : PREVENTION OF STICKING OF GRANULE AND FINE PARTICLE

ABSTRACT : PURPOSE: To prevent sticking of granules or fine particles by mixing the granules or fine particles with a specific sticking preventive agent such as talc and molding the mixture.

CONSTITUTION: Granules or fine particles of medicines or the like are mixed with a sticking preventive agent selected from the group consisting of talc, calcium stearate, magnesium stearate, hydrous silicic acid, light silicic anhydride, crystalline cellulose, hydroxypropyl cellulose of low degree of substitution, starch, carnauba wax, carboxymethylcellulose, magnesium silicate, aluminum silicate and magnesium metasilicate aluminate and the mixture is molded. The sticking preventive agent is of $\leq 50\mu\text{m}$ grain size and is compounded at about 0.2~3wt% with the granules or fine particles. The coating granules obtd. by spraying a coating agent thereto has a small angle of repose and is sticking- free.

COPYRIGHT: (C)1984,JPO&Japio

⑫ 公開特許公報 (A)

昭59—49840

⑬ Int. Cl.³
B 01 J 2/30

識別記号

庁内整理番号
6639—4G

⑭ 公開 昭和59年(1984) 3月22日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑮ 顆粒、細粒の固着防止方法

⑯ 特 願 昭57—160419 ✓

⑰ 出 願 昭57(1982) 9月14日

⑱ 発 明 者 大平一夫
高山市西之一色町 3 丁目 551 番
地

⑲ 発 明 者 長谷川孝人

高山市上岡本町 3 丁目 1800 番地

⑳ 発 明 者 安達英夫
高山市西之一色町 3 丁目 551 番
地㉑ 出 願 人 大洋薬品工業株式会社
高山市西之一色町 2 丁目 181 番
地

㉒ 代 理 人 弁理士 有賀三幸 外 2 名

明 細 書

1. 発明の名称

顆粒、細粒の固着防止方法

2. 特許請求の範囲

1. 顆粒または細粒を、タルク、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム、含水ケイ酸、無水ケイ酸、結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、デンプン、カルナウバロウ、カルボキシメチルセルロース、ケイ酸マグネシウム、ケイ酸アルミニウム及びメタケイ酸アルミニウムよりなる群から選ばれた固着防止剤と混合することを特徴とする顆粒、細粒の固着防止方法。

2. 顆粒または細粒が、水溶性フィルムまたは水膨潤性フィルムでコーティングされたものである特許請求の範囲第 1 項記載の固着防止方法。

3. 固着防止剤の添加量が顆粒または細粒の 0.2 ~ 1 重量% である特許請求の範囲第 1 項記載の固着防止方法。

3. 発明の詳細な説明

本発明は顆粒、細粒の新規な固着防止方法に関する。

薬剤等の顆粒、細粒には一般に呈味性の改善、光等による変質防止、腐蝕性、持効性の付与等の目的で種々のコーティングが施されている。

従来、コーティング剤としては、有機溶媒可溶性フィルム、水溶性フィルム、水膨潤性フィルム等が使用されているが、有機溶媒可溶性フィルムは工場の安全及び作業者の労働衛生において難点があるため、引火性のないヒドロキシプロピルセルロース (HPO)、ヒドロキシプロピルメチルセルロール (TC-5)、ポリビニルピロリドン (PVP) 等の水溶性フィルム又はオイドラゲッドリタード顆粒 (商品名) 等の水膨潤性フィルムが多用されている。

しかし、水溶性フィルム、水膨潤性フィルムでコーティングされた顆粒又は細粒は、空気中の湿気を吸収して顆粒又は細粒同士が固着してしまいうため、湿気を透過させない保存容器、例えば気密ガラス瓶などに入れて保存するか、あるいは乾燥

剤を容器に入れて保存する必要があつた。しかし、斯くして保存しても一旦開放すると湿気によつて固着してしまうため、次回からは投与量の正確な秤量が困難であるという欠点があつた。

また、顆粒、細粒は一回の投与にずつに分けて容器に充填されることが多く、この場合の容器として、通常ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリエステル等のプラスチックとセロファンの複合袋が使用されているが、このようなプラスチック類の容器は空気中の湿気を透過させるため長期間保存すると、水溶性フィルム、水膨性フィルムでコーティングした顆粒又は細粒が容器内で固着して、顆粒又は細粒の外観を著しく悪化させたり、又内容物によつては着色する等の難点があつた。

斯かる実情において、本発明者は鋭意研究を行った結果、従来から薬剤の賦形剤として使用されている物質を固着防止剤として少量添加すれば顆粒又は細粒の固着を防止できることを見出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は、顆粒または細粒を、タル

プロピルセルロース9部の5成分を混合し、50%イソプロパノールにて練合し、次いで造粒し、マルメライザーにて球形化した後乾燥し、12~48メッシュに整粒し顆粒を製した。次にヒドロキシプロピルメチルセルロース(TC-5)8部、マクロゴール4000 1部、酸化チタン1部を50%メタノール溶液に溶解したコーティング剤を用いて顆粒に流動層乾燥機中で噴霧してコーティングを行ないコーティング顆粒を製した。

(2) 固着試験

(1)で調製した顆粒10gに1%の固着防止剤を添加したものをビーカーに入れ、相対湿度80%、84%、90%でそれぞれ3日、5日、7日間保存し、その外観及び安息角を測定した。尚、対照には固着防止剤を添加しないものを用いた。

(3) 固着の判定

通常安息角が40°以下の顆粒は流動性がよいが、安息角が41~45°では部分的に固着が認められ、46°以上特に50°以上では顆粒が固着して、顆粒塊を形成するので、固着の判定は以下の安息角で

ク、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム、含水ケイ酸、塩化加水ケイ酸、結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、デンプン、カルナウバロウ、カルボキシメチルセルロース、ケイ酸マグネシウム、ケイ酸アルミニウム及びメタケイ酸アルミン酸マグネシウムよりなる群から選ばれた固着防止剤と混合することを特徴とする顆粒、細粒の固着防止方法である。

本発明で使用する固着防止剤は粒径50μm以下、特に20μm以下の微粉末のものが好ましく、その配合量は顆粒又は細粒の0.2~3重量%、特に0.5~2重量%が好ましい。そして、このような固着防止剤の上記量の配合は日本薬局方の顆粒剤、細粒剤の規格に適合するものである。

次に実施例を挙げて説明する。尚、重量部で示した。

実施例

(1) 顆粒剤の調整

イブプロフェン20部、結晶セルロース20部、乳糖20部、コーンスターチ20部、ヒドロキシ

判定した。

尚、固着して顆粒塊となつていゝものはこの塊をくずして安息角を測定した。

判定

- (一) 固着なし：安息角40°以下で固着が認められないもの、
- (二) やや固着：安息角41°~45°で、部分的に固着が認められないもの、
- (三) 固着あり：安息角46°以上又は固着が認められるもの

(4) 結果は表1の通りである。

以下省略

表 1

保存条件 保存期間(日)		相 対 歪 度					
		80%		84%		90%	
固着防止剤		安息角	判 定	安息角	判 定	安息角	判 定
無	3	39°	—	42°	±	45°	±
	5	42°	±	42°	±	*48°	+
	7	45°	±	46°	+	*50°	+
タルク	3	36°	—	35°	—	37°	—
	5	36°	—	37°	—	38°	—
	7	37°	—	38°	—	40°	—
ステアリン酸 カルシウム	3	35°	—	36°	—	36°	—
	5	36°	—	36°	—	38°	—
	7	37°	—	37°	—	39°	—
ステアリン酸 マグネシウム	3	35°	—	36°	—	36°	—
	5	35°	—	37°	—	39°	—
	7	37°	—	38°	—	39°	—
含水ケイ酸	3	34°	—	35°	—	37°	—
	5	35°	—	35°	—	37°	—
	7	35°	—	35°	—	37°	—
軽質無水ケイ酸	3	34°	—	34°	—	36°	—
	5	34°	—	35°	—	35°	—
	7	35°	—	35°	—	36°	—
結晶セルロース	3	37°	—	37°	—	38°	—
	5	38°	—	39°	—	39°	—
	7	40°	—	40°	—	41°	±
低置換度ヒドロキシ プロピルセルロース	3	37°	—	38°	—	39°	—
	5	38°	—	40°	—	40°	—
	7	39°	—	40°	—	41°	±
デンプン	3	38°	—	39°	—	40°	—
	5	39°	—	40°	—	41°	±
	7	39°	—	41°	±	42°	±
カルナウパロウ	3	37°	—	37°	—	38°	—
	5	38°	—	38°	—	40°	—
	7	38°	—	38°	—	40°	—
ケイ酸アルミニウム	3	36°	—	36°	—	37°	—
	5	37°	—	37°	—	38°	—
	7	37°	—	38°	—	39°	—
メタケイ酸アルミ ン酸マグネシウム	3	37°	—	37°	—	38°	—
	5	38°	—	39°	—	40°	—
	7	39°	—	39°	—	40°	—

*は固着し塊となつたもの